

**VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT  
AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS**

**PCT**

**INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT**

(Artikel 18 sowie Regeln 43 und 44 PCT)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts <b>101D196ve/rs</b>	<b>WEITERES VORGEHEN</b>	siehe Mitteilung über die Übermittlung des internationalen Recherchenberichts (Formblatt PCT/ISA/220) sowie, soweit zutreffend, nachstehender Punkt 5	
Internationales Aktenzeichen <b>PCT/EP 02/12533</b>	Internationales Anmelde datum (Tag/Monat/Jahr) <b>08/11/2002</b>	(Frühestes) Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) <b>24/12/2001</b>	
Anmelder <b>MERCK PATENT GMBH</b>			

Dieser internationale Recherchenbericht wurde von der Internationalen Recherchenbehörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 18 übermittelt. Eine Kopie wird dem Internationalen Büro übermittelt.

Dieser internationale Recherchenbericht umfaßt insgesamt 07 Blätter.  
 Darüber hinaus liegt ihm jeweils eine Kopie der in diesem Bericht genannten Unterlagen zum Stand der Technik bei.

**1. Grundlage des Berichts**

a. Hinsichtlich der **Sprache** ist die internationale Recherche auf der Grundlage der internationalen Anmeldung in der Sprache durchgeführt worden, in der sie eingereicht wurde, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.

Die internationale Recherche ist auf der Grundlage einer bei der Behörde eingereichten Übersetzung der internationalen Anmeldung (Regel 23.1 b)) durchgeführt worden.

b. Hinsichtlich der in der Internationalen Anmeldung offenbarten **Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz** ist die internationale Recherche auf der Grundlage des Sequenzprotokolls durchgeführt worden, das

in der internationalen Anmeldung in schriftlicher Form enthalten ist.

zusammen mit der internationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.

bei der Behörde nachträglich in schriftlicher Form eingereicht worden ist.

bei der Behörde nachträglich in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.

Die Erklärung, daß das nachträglich eingereichte schriftliche Sequenzprotokoll nicht über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinausgeht, wurde vorgelegt.

Die Erklärung, daß die in computerlesbarer Form erfaßten Informationen dem schriftlichen Sequenzprotokoll entsprechen, wurde vorgelegt.

2.  Bestimmte Ansprüche haben sich als nicht recherchierbar erwiesen (siehe Feld I).

3.  Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung (siehe Feld II).

4. Hinsichtlich der **Bezeichnung der Erfindung**

wird der vom Anmelder eingereichte Wortlaut genehmigt.

wurde der Wortlaut von der Behörde wie folgt festgesetzt:  
**PYRROLOPYRIMIDINE ALS PHOSPHODIESTERASE-VII-HEMMER**

5. Hinsichtlich der **Zusammenfassung**

wird der vom Anmelder eingereichte Wortlaut genehmigt.

wurde der Wortlaut nach Regel 38.2b) in der in Feld III angegebenen Fassung von der Behörde festgesetzt. Der Anmelder kann der Behörde innerhalb eines Monats nach dem Datum der Absendung dieses internationalen Recherchenberichts eine Stellungnahme vorlegen.

6. Folgende Abbildung der **Zeichnungen** ist mit der Zusammenfassung zu veröffentlichen: Abb. Nr. \_\_\_\_\_

wie vom Anmelder vorgeschlagen

weil der Anmelder selbst keine Abbildung vorgeschlagen hat.

weil diese Abbildung die Erfindung besser kennzeichnet.

keine der Abb.

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT 02/12533

**A. KLASIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES**  
 IPK 7 C07D487/04 A61K31/505 // (C07D487/04, 239:00, 209:00)

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

**B. RECHERCHIERTE GEBIETE**

Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)  
 IPK 7 C07D A61K

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

CHEM ABS Data

**C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN**

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	K. EGER ET AL.: "Selected Reactions on the o-Aminonitrile System of Substituted Pyrroles" J. HETEROCYCL. CHEM., Bd. 24, Nr. 2, 1987, Seiten 425-430, XP002229256 * Schemes I-III *	1-8
X	C. E. MÜLLER ET AL.: "7-Deaza-2-phenyladenines: Structure-Activity Relationships of Potent A1 Selective Receptor Antagonists" J. MED. CHEM., Bd. 33, Nr. 10, 1990, Seiten 2822-2828, XP002229257 Tabelle I	1-8 -/-

Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

Siehe Anhang Patentfamilie

- \* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :
- \*A\* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist
- \*E\* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist
- \*L\* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)
- \*O\* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht
- \*P\* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

- \*T\* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist
- \*X\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erforderlicher Tätigkeit beruhend betrachtet werden
- \*Y\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erforderlicher Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist
- \*&\* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der Internationalen Recherche

13. März 2003

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

20/03/2003

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde  
 Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2  
 NL - 2280 HV Rijswijk  
 Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
 Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Herz, C

## INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PC 02/12533

## C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	M. ADENOT ET AL.: "Interest of cluster significance analysis in structure-affinity relationships for non-xanthine heterocyclic antagonists of adenosine" EUR. J. MED. CHEM., Bd. 32, Nr. 6, 1997, Seiten 493-504, XP002229258 Tabelle IV ---	1-8
X	A. MIYASHITA ET AL.: "Preparation of heteroarenenecarbonitriles by reaction of haloheteroarenes with potassium cyanide catalyzed by sodium p-toluenesulfinate" HETEROCYCLES, Bd. 39, Nr. 1, 1994, Seiten 345-356, XP009004660 Tabelle I ---	1-8
X	G. FOLKERS, H.-D. HÖLTJE: "Active site molecular modelling of xanthine oxidase inhibitors with antiinflammatory activity" J. MOLECULAR GRAPHICS, Bd. 3, Nr. 4, 1985, Seiten 146-150, XP009004653 Tabelle 1 ---	1-8
X	D. STEINHILBER ET AL.: "New Class of 5-Lipoxygenase Inhibitors: Correlation Between Inhibition of LTB4 Production and Chemiluminescence of Human Polymorphonuclear Granulocytes" PHARM. RESEARCH, Bd. 3, Nr. 5, 1986, Seiten 271-277, XP009004659 Tabellen II, III ---	1-8
X	F. JOHANNSEN ET AL.: "Reactions of Heterocyclic o-Aminonitriles with Acetic Formic Anhydride" CHEMICA SCRIPTA, Bd. 26, Nr. 2, 1986, Seiten 347-351, XP009004655 Tabelle II ---	1-8
X	H. J. ROTH, K. EGER: "Synthese von Pyrrolo'2,3-d!pyrimidinen" ARCH. PHARMAZ., Bd. 308, Nr. 4, 1975, Seiten 252-258, XP002059633 Tabelle 1 ---	1-8
		-/-

## INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/DE 02/12533

## C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	J. W. DALY ET AL.: "7-Deaza-9-phenyladenines. A new class of adenosine receptor antagonists" BIOCHEM. PHARMACOL., Bd. 37, Nr. 19, 1988, Seiten 3749-3753, XP002928089 Tabelle 1 ---	1-8
X	A. O. ABDELHAMID ET AL.: "Reactions with heterocyclic enaminonitriles: synthesis of pyrrolo'2,3-b!pyridine, pyrrolo'2,3-d!pyrimidine and pyrrole derivatives" HETEROCYCLES, Bd. 27, Nr. 8, 1988, Seiten 1861-1866, XP000973572 Tabelle 1 ---	1-3
X	S. KLUMPP ET AL.: "Pyrrolo'2,3-d!pyrimidines as inhibitors of cAMP Phosphodiesterase" BIOCHEM. PHARMACOL., Bd. 38, Nr. 6, 1989, Seiten 949-953, XP001117494 Tabelle 1 ---	1-20
X	A. MIYASHITA ET AL.: "Catalytic Action of Azolium Salts. IX. Synthesis of 6-Aroyl-9H-purines and Their Analogues by Nucleophilic Aroylation Catalyzed by Imidazolium or Benzimidazolium Salt" CHEM. PHARM. BULL., Bd. 46, Nr. 3, 1998, Seiten 390-399, XP001135025 * Charts 1-8 *	1-3
A	G. FOLKERS: "Rezeptoraffinität von Xanthinoxidase-Inhibitoren - strukturelle Voraussetzungen" DEUTSCHE APOTHEKER ZEITUNG, Bd. 126, Nr. 41, 1986, Seiten 2243-2247, XP001135024 * Abb. 3 * ---	1-23
X	EP 0 005 205 A (TROPONWERKE GMBH & CO. KG) 14. November 1979 (1979-11-14) Ansprüche 1-10 ---	1-3, 13
A	EP 0 482 804 A (ICI PLC) 29. April 1992 (1992-04-29) Ansprüche 1-10 ---	1-23
X	DE 31 45 287 A (TROPONWERKE GMBH & CO. KG) 19. Mai 1983 (1983-05-19) Ansprüche 1-10 ---	1-3, 13

-/--

## INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT 02/12533

## C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie <sup>a</sup>	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 94 13676 A (PFIZER INC.) 23. Juni 1994 (1994-06-23) Ansprüche 1-1 ---	1-3, 13
A	WO 01 57025 A (PFIZER PRODUCTS INC.) 9. August 2001 (2001-08-09) Ansprüche 1-10 ---	1-23
A	WO 01 29049 A (MERCK PATENT GMBH) 26. April 2001 (2001-04-26) Ansprüche 1-4 ---	1-23
A	WO 01 34601 A (MERCK PATENT GMBH) 17. Mai 2001 (2001-05-17) Ansprüche 1-6 ---	1-23
A	WO 01 32618 A (MERCK PATENT GMBH) 10. Mai 2001 (2001-05-10) Ansprüche 1-3 -----	1-23

**INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT**

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT 02/12533

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung		Mitglied(er) der Patentfamilie		Datum der Veröffentlichung
EP 5205	A	14-11-1979	DE	2818676 A1		08-11-1979
			AT	368501 B		25-10-1982
			AT	317679 A		15-02-1982
			DE	2960769 D1		26-11-1981
			DK	174079 A		28-10-1979
			EP	0005205 A1		14-11-1979
			ES	479970 A1		16-11-1979
			FI	791342 A		28-10-1979
			JP	54144395 A		10-11-1979
			NO	791150 A		30-10-1979
			(US)	4229453 A		21-10-1980
EP 482804	A	29-04-1992	AT	148119 T		15-02-1997
			AU	8581391 A		02-07-1992
			CA	2053626 A1		19-04-1992
			DE	69124335 D1		06-03-1997
			EP	0482804 A1		29-04-1992
			FI	914910 A		19-04-1992
			IE	913598 A1		22-04-1992
			JP	4273878 A		30-09-1992
			NZ	240180 A		23-12-1993
			PT	99264 A		31-08-1992
			(US)	5328910 A		12-07-1994
			ZA	9108134 A		29-07-1992
DE 3145287	A	19-05-1983	DE	3145287 A1		19-05-1983
WO 9413676	A	23-06-1994	AT	177101 T		15-03-1999
			AU	690090 B2		23-04-1998
			AU	5666494 A		04-07-1994
			BR	9307646 A		25-05-1999
			CA	2150016 A1		23-06-1994
			CN	1097758 A , B		25-01-1995
			CZ	9501584 A3		17-01-1996
			DE	69323768 D1		08-04-1999
			DE	69323768 T2		01-07-1999
			DK	674641 T3		27-09-1999
			EP	0674641 A1		04-10-1995
			ES	2128544 T3		16-05-1999
			FI	935585 A		18-06-1994
			FI	20000343 A		16-02-2000
			GR	3029561 T3		30-06-1999
			HU	70505 A2		30-10-1995
			IL	107897 A		28-01-2001
			IL	119461 A		29-02-2000
			IL	119462 A		29-02-2000
			JP	2895961 B2		31-05-1999
			JP	7509726 T		26-10-1995
			KR	173172 B1		01-02-1999
			NO	952398 A		16-06-1995
			NZ	258690 A		29-01-1997
			PL	309357 A1		02-10-1995
			RU	2124015 C1		27-12-1998
			WO	9413676 A1		23-06-1994
			ZA	9309271 A		12-06-1995
WO 0157025	A	09-08-2001	AU	2700301 A		14-08-2001
			EP	1252157 A1		30-10-2002

**INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT**

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT

02/12533

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung		Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 0157025	A		WO 0157025 A1 NO 20023614 A	09-08-2001 30-09-2002
WO 0129049	A	26-04-2001	DE 19950647 A1 AU 1135601 A BR 0014922 A CN 1382146 T CZ 20021251 A3 WO 0129049 A2 EP 1222193 A2 HU 0203139 A2 NO 20021846 A SK 4922002 A3	26-04-2001 30-04-2001 11-06-2002 27-11-2002 17-07-2002 26-04-2001 17-07-2002 28-01-2003 19-04-2002 10-09-2002
WO 0134601	A	17-05-2001	DE 19953414 A1 AU 1387201 A BR 0015324 A CN 1387530 T CZ 20021416 A3 WO 0134601 A2 EP 1226143 A2 HU 0203245 A2 NO 20022124 A SK 5732002 A3	10-05-2001 06-06-2001 09-07-2002 25-12-2002 14-08-2002 17-05-2001 31-07-2002 28-01-2003 03-05-2002 10-09-2002
WO 0132618	A	10-05-2001	DE 19953025 A1 AU 1387301 A BR 0015334 A CN 1382122 T CZ 20021440 A3 WO 0132618 A1 EP 1230215 A1 HU 0203288 A2 NO 20022125 A SK 5952002 A3	10-05-2001 14-05-2001 09-07-2002 27-11-2002 17-07-2002 10-05-2001 14-08-2002 28-01-2003 03-05-2002 10-09-2002